

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11) Publication number : 04-169511

(43) Date of publication of application : 17.06.1992

(51) Int.Cl.

A61K 7/00

(21) Application number : 02-291881

(71) Applicant : POLA CHEM IND INC
KURARAY CO LTD

(22) Date of filing :

31.10.1990

(72) Inventor :

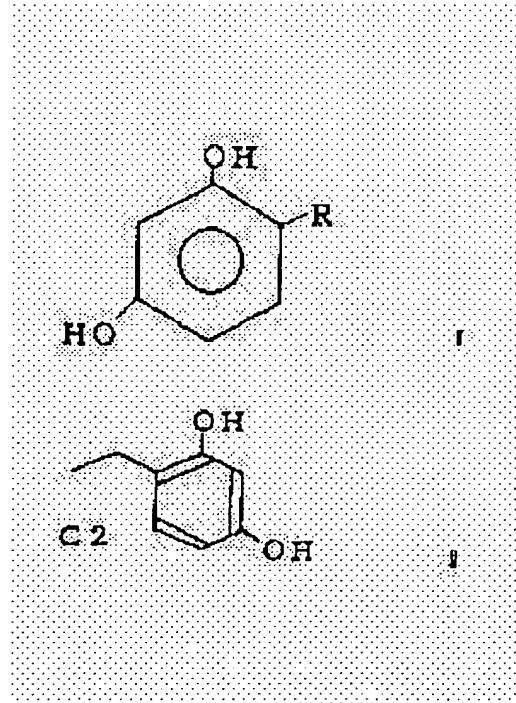
NODA MARIKO
MATSDA KAZUO
TAKENOUCHI MASANORI
SOTOOKA NORIAKI
YAMANE TAKESHI
TORIHARA MASAHIRO
TAMAI HIRONOBU

(54) COSMETIC FOR COMMON ACNE

(57) Abstract:

PURPOSE: To obtain a cosmetic for common acne, capable of exhibiting remarkably inhibitory effects on the common acne and excellent also in safety by blending a specific amount of a specified resorcinol derivative having antimicrobial action in a cosmetic.

CONSTITUTION: A cosmetic for common acne is obtained by blending a resorcinol derivative (e.g. resorcinol expressed by formula II) expressed by formula I (R is 2-12C straight-chain or branched alkyl) in an amount of at least 0.001wt.% (0.1-2wt.% is especially preferred) based on the total amount of the cosmetic composition for the common acne. The aforementioned cosmetic has powerful action on germs producing or worsening the common acne. The above-mentioned cosmetic for the common acne is used as cream, milky lotion, toilet water, pack, soap, etc.



⑫ 公開特許公報 (A) 平4-169511

⑬ Int. Cl. 5

A 61 K 7/00

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 平成4年(1992)6月17日

C 9051-4C
Y 9051-4C

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全6頁)

⑮ 発明の名称 ニキビ用化粧料

⑯ 特 願 平2-291881

⑯ 出 願 平2(1990)10月31日

⑰ 発明者 野田 万利子 神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1 ポーラ化成工業
株式会社横浜研究所内

⑰ 発明者 松田 和夫 神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1 ポーラ化成工業
株式会社横浜研究所内

⑰ 発明者 竹ノ内 正紀 神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1 ポーラ化成工業
株式会社横浜研究所内

⑰ 出願人 ポーラ化成工業株式会社 静岡県静岡市弥生町6番48号

⑰ 出願人 株式会社クラレ 岡山県倉敷市酒津1621番地

⑰ 代理人 弁理士 大多和 明敏 外1名

最終頁に続く

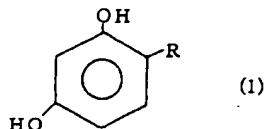
明細書

1. 発明の名称

ニキビ用化粧料

2. 特許請求の範囲

一般式 (1)



(式中、Rは炭素数2~12の直鎖あるいは分枝アルキル基を表わす。)

で示されるレゾルシノール誘導体を少なくとも0.001重量%配合してなるニキビ用化粧料。

3. 発明の詳細な説明

〔産業上の利用分野〕

本発明は、ニキビ用化粧料に関し、更に詳しくは抗菌作用を有する化合物を含有するニキビ抑制効果の優れたニキビ用化粧料に関する。

〔従来の技術〕

ニキビの発生の原因としては、内分泌異常、細

菌感染、脂質代謝および糖代謝異常、ビタミンA群及びB群の欠乏、消化器障害、脂肪・糖分の過剰摂取、遺伝子的因子等であると言われている。

ニキビ、特に尋常性ニキビには好気性菌~~Staphylococcus epidermidis~~及び嫌気性菌~~Propionibacterium acnes~~が多く検出され、これらの菌、特に嫌気性菌~~Propionibacterium acnes~~はニキビを悪化させるものであることが報告されている〔皮膚臨床, 23, (6)特: 21,499~505(1981)〕。

従来のニキビ抑制剤としてはレゾルシン、イソプロピルメチルフェノール等が知られている。

〔発明が解決しようとする課題〕

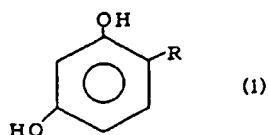
前記従来のニキビ抑制剤はいずれもニキビの発生および悪化させる要因と言われる~~Propionibacterium acnes~~等の菌に対して抗菌作用が弱く、ニキビの抑制効果の高い素材とは言い難いものであり、従って、従来はニキビ抑制剤を多量に使用せざるを得ず、そのためそれらを配合す

る化粧品等の安定化や安全性に問題があり、ニキビ抑制効果が高く安全性等の点で問題のないニキビ用化粧料の開発が要望されている。

〔課題を解決するための手段〕

本発明者らは、ニキビ抑制効果の高いニキビ用化粧料について種々研究の結果、特定のレゾルシノール誘導体がニキビの発生及び悪化させる菌に対して抗菌作用が強く、これらを含有するニキビ用化粧料がニキビ抑制効果の優れたものであることを見出し、本発明に到達したものである。

即ち、本発明は一般式(1)



(式中、Rは炭素数2～12の直鎖あるいは分枝アルキル基を表わす。)

で示されるレゾルシノール誘導体を少なくとも0.001重量%配合してなるニキビ用化粧料に関する。

上記一般式(1)で表わされるレゾルシノール誘導体のRは炭素数2～12の直鎖あるいは分枝アルキル基であり、直鎖アルキル基としては、エチル基、プロピル基、ブチル基、ベンチル基、ヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基、ウンデシル基およびドデシル基が挙げられる。又、分枝アルキル基は水素原子の1個がメチル基等の低級アルキル基で置換されていたものであり、その具体例としてはイソプロピル基、イソブチル基、イソアミル基、2-メチルヘキシル基等が挙げられる。

本発明のレゾルシノール誘導体の具体的化合物を例示すると第1表の通りである。

第1表

番号	化学構造式
No. 1	
No. 2	

No. 3	
No. 4	
No. 5	
No. 6	
No. 7	

一般式(1)で表わされるレゾルシノール誘導体は公知の化合物であり、例えば飽和のカルボン酸とレゾルシノールを塩化亜鉛の存在下で縮合させた後、縮合物を亜鉛アマルガム／塩酸で還元する方法 (Lille. J. Bitter, L.A. Peiner. V, Tr. Nauch-Tealed. Inst. slautaev 1969, No 18, 127)、あるいはレゾルシノールの対応するアルキルアルコールとをアルミナ触媒を使用して200～400℃の高温下で反応させて得る方法 (英国特許第1,581,428号) 等によって容易に得ることができる。

一般式(1)で表わされるレゾルシノール誘導体の配合割合はニキビ用化粧料組成物全量に対して少なくとも0.001重量%であり、特に好ましい量は0.1～2重量%である。0.001重量%より低濃度では、ニキビ抑制効果が弱くなり、本発明の目的を達成し得なくなる。一方、2重量%より高濃度では使用してもニキビ抑制効果はそれほど上がりがない。

本発明のニキビ用化粧料は、前記レゾルシノール

ル誘導体の他にニキビ用化粧料に通常用いられる各種成分が配合され得、特に限定されるものではない。

本発明のニキビ用化粧料の具体的剤型としてはクリーム、乳液、化粧水、パック、石けん等が挙げられる。

ニキビ用化粧料の基剤としては、炭化水素類、各種のエステル類、ロウ類、油脂類、高級脂肪酸類、高級アルコール類、水溶性高分子、粉体、界面活性剤、多価アルコール類などの1種又は2種以上の組合せを挙げることができ、また、添加成分としては、香料、色素、防腐剤、抗酸化剤、紫外線吸収剤、その他にも様々な薬効成分、例えばヒアルロン酸、アラントイン、ビタミン類、アミノ酸、胎盤エキスなどを挙げることが出来、これらの1種又は2種以上を組合せて適宜配合することが出来る。

【作用】

本発明のレゾルシノール誘導体はニキビの発生及び悪化を促進する微生物に対する抗菌作用が強

く、これを配合したニキビ用化粧料はニキビ抑制効果を有する。

【実施例】

以下、実施例にて本発明を具体的に説明するが、本発明は、これら実施例に限定されるものではない。なお、配合量は重量部である。

(1) レゾルシノール誘導体の抗菌力試験

〈実験方法と結果〉

(試料)

各サンプルを15%エタノール水溶液に溶解させたもの

(実験方法)

カップ法による阻止円測定

〈測定方法〉

滅菌シャーレにてプロピオニバクテリウムアクネスの生理的食塩水分散液(菌数 10^8 / ml) 0.2mlと滅菌したブレインハートインフュージョン寒天培地(栄研化学(株)製)約20mlとを混和し、固化・乾燥させる。

その後、カップ(内径8mm)を上記混和培地上

に置き、カップ内に各試料を0.3ml入れ37℃にて6日間嫌気的に培養する。培養終了後カップを取り除き阻止円の直径を測定する。結果を第2表に示す。

第2表 阻止円(mm)

サンプル	サンプル濃度	プロピオニバクテリウムアクネス					
		0.01%	0.03%	0.05%	0.1%	0.5%	1.0%
本発明品	V/Vシード液 No.3	8.0	12.6	16.5	23.8	45.9	47.6
	V/Vシード液 No.2	8.0	19.5	27.7	36.3	44.7	47.9
従来品	レゾルシン	0	0	0	0	0	8.0
	ハイドロキノン	0	0	0	0	0	8.0
溶媒(15%エタノール)		0					

第2表から明らかなように、本発明のレゾルシノール誘導体の阻止円は大であり、従来品と比較してニキビを抑制する効果に優れていることがわかる。

(2) 急性毒性試験

レゾルシノール誘導体又は比較化合物としてハイドロキノンを生理食塩水に溶解し、これを1群10匹のddy系雄性マウスに経口投与(p.o.)、腹腔内投与(i.p.)、及び皮下投与(s.c.)し、投与後24時間までの生死を観察した。その結果に基づきLD₅₀をリテフィールド- wilコキソム(Litchfield-Wilcoxon)法にしたがって算出した。その結果を第3表に示す。

第3表

化合物	LD ₅₀ (mg/kg)		
	1.p.	s.c.	p.o.
No. 4	334.8	>500	>500
No. 3	268.8	>500	>500
ハイドロキノン	144.0	338.8	489.0

実施例1 化粧水

(処方)

第4表

原料名	実施例1	比較例1	比較例2
エタノール	10	10	10
グリセリン	2	2	2
ポリオキシエチレン 硬化ヒマシ油 (50E.O.)	1	1	1
エチルバラベン	0.05	0.05	0.05
香料	0.05	0.05	0.05
クエン酸	0.1	0.1	0.1
クエン酸ナトリウム	0.15	0.15	0.15
レゾルシノール誘導体No.3	0.5		
イソプロピルメチル フェノール			0.5
精製水	86.15	86.65	86.15

(製法)

全量を80℃に加熱し、ホモミキサーで均質に可溶化する。室温まで冷却し、容器につめて製品とする。

実施例2 乳液

(処方)

第5表

原料名	実施例2
ホホバ油	4
ラノリン	1
セタノール	1
流動パラフィン	0.5
ポリオキシエチレンモノオレイン酸 ソルビタン (20E.O.)	1.5
モノオレイン酸ソルビタン	1
香料	0.1
1, 3-ブチレングリコール	3
レゾルシノール誘導体No.3	0.8
精製水	87.1

(製法)

全量を80℃に加熱し、ホモミキサーで均質に乳化する。室温まで冷却し、容器につめて製品とする。

実施例3 クリーム

(処方)

第6表

原料名	実施例3
ステアリン酸	16
ポリオキシエチレンモノオレイン酸 ソルビタン (20E.O.)	1.5
モノステアリン酸ソルビタン	2
プロピルバラベン	0.1
香料	0.1
1, 3-ブチレングリコール	10
レゾルシノール誘導体No.3	1.0
精製水	69.75

(製法)

全量を80℃に加熱し、ホモミキサーで均質に乳化する。室温まで冷却し、容器につめて製品とする。

<ニキビ治療試験>

(試料)

実施例1, 2, 3 及び比較例1, 2

(試験方法)

脂性肌であり且つニキビが顔面部位に存在する女子50名をパネラーとし、1群を10名として、各群毎に上記試料を1日2回通常の使用状態と同様に塗布し、これを30日間続けた後、ニキビの改善度について専門家が評価した。

(結果)

試料	(単位:名)				
	効果なし	効果稍々あり	効果あり	効果非常にあり	
実施例1	5	2	2	1	
実施例2	3	2	2	3	
実施例3	2	2	3	3	
比較例1	9	1	0	0	
比較例2	7	2	1	0	

第7表から明らかなように、本発明品はニキビを有する皮膚に適用することにより明らかなニキビの改善効果がある。これはニキビの増悪因子であるプロピオニバクテリウム アクネス (*Propionibacterium acnes*)を殺菌することによりニキビ

を改善できるものである。

〔発明の効果〕

レゾルシノール誘導体を少なくとも0.001重量%配合したニキビ用化粧料には、顕著なニキビ抑制効果が認められ、安全性の点でも優れたものである。

特許出願人 ポーラ化成工業株式会社

特許出願人 株式会社 クラレ

代理人 大多和 明敏

代理人 大多和 麻子

第1頁の続き

②発明者	外岡 憲明	神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1	ポーラ化成工業
		株式会社横浜研究所内	
②発明者	山根 武	新潟県北蒲原郡中条町倉敷町2番28号	株式会社クラレ内
②発明者	鳥原 正浩	新潟県北蒲原郡中条町倉敷町2番28号	株式会社クラレ内
②発明者	玉井 洋進	新潟県北蒲原郡中条町倉敷町2番28号	株式会社クラレ内

手続補正書

平成3年9月30日

特許庁長官 殿

1. 事件の表示

平成2年特許願第291881号

2. 発明の名称

ニキビ用化粧料

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 静岡県静岡市弥生町648番地

名称 ボーラ化成工業株式会社

代表者 鈴木 常司

住所 岐阜県倉敷市酒津1621番地

名称 株式会社 クラレ

代表者 中村 尚夫

4. 代理人

住所 東京都港区西新橋二丁目3番2号
ニュー栄和ビル 電話(3501)2506番

氏名 弁理士(8931) 大多和明 教

住所 同所

氏名 弁理士(8699) 大多和明 教

5. 補正命令の日付 自発補正

6. 補正により増加する発明の数 なし

7. 補正の対象

明細書の「発明の詳細な説明」の欄。

8. 補正の内容

(1) 明細書第9頁

第2表を以下の通りに訂正する。

第2表 阻止円(μm)

サンプル	サンプル濃度	プロピオニバクテリウム アクネス					
		0.01%	0.03%	0.05%	0.1%	0.5%	1.0%
本発明品	レゾルシノール誘導体 No.1	8.0mm	8.0	8.0	12.5	30.4	34.3
	レゾルシノール誘導体 No.2	8.0	19.5	27.7	36.3	44.7	47.9
	レゾルシノール誘導体 No.3	8.0	12.6	16.5	23.8	45.9	47.6
	レゾルシノール誘導体 No.5	8.0	8.5	12.3	18.8	36.0	38.1
	レゾルシノール誘導体 No.7	8.0	8.0	8.0	10.1	20.8	23.7
従来品	レゾルシン	0	0	0	0	0	8.0
	イカビゲチノール	0	0	0	0	0	8.0
	溶媒(15%エタノール)						0

特許庁

(2) 同第9頁、下から第4行～最下行

「第2表・・・ことがわかる。」なる記載を以下の通りに訂正する。

「第2表から明らかなように、本発明のレゾルシノール誘導体の式中Rの炭素数2～12において、N_{o.}1(炭素数2)及びN_{o.}7(炭素数12)はN_{o.}2(炭素数4), N_{o.}3(炭素数5)及びN_{o.}5(炭素数8)よりもその阻止円は小さいが従来品よりはるかに大きく、本発明のレゾルシノール誘導体の式中Rの炭素数2～12がニキビを抑制する効果に優れていることがわかる。」